10/535/US Rec'd PT/PTO 20 MAY 2005

特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告(特許協力各約第一会)

REC'D 1 6 DEC 2004
WIPO PCT

(法第12条、法施行規則第56条) [PCT36条及びPC丁規則70]

出題人又は代理人 の書類記号 KW0131	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。
国際出願番号 PCT/JP03/15154	国際出願日 (日.月.年) 27.11.2003 優先日 (日.月.年) 28.11.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl' C07D 235/28, C07	7D 295/18
出願人 (氏名又は名称)	
	與和株式会社
1 204144	
1. この報告替は、PCT35条に基づき 法施行規則第57条 (PCT36条)の	この国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 D規定に従い送付する。
	合めて全部で4 ページからなる。
3.この報告には次の附属物件も添付され a	している。 ページである。
補正されて、この報告の基礎 用及びノソけ図面の用紙(P	シネカを及びノフルトの同時でではない。
	01/88/10.10次 0
	たように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの 差替え用紙
b 間子媒体は全部で	
配列表に関する補充欄に示すよ ブルを含む。(実施細則第80	うに、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテー
アル これで、(突爬麻叭粥80	2号参照)
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含	会do
·	i di
第14個 優先権	
・ □ 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又 □ 第Ⅳ欄 発明の単一性の欠	は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
図 第V欄 PCT35条(2)	と規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性に こころころ
けるための文献及 ダ 第VI欄 ある種の引用文献	
■ 第VI欄 国際出願の不備	
□ 第四個 国際出願に対する	意見
国際予備審査の請求書を受理した日	可吹又 供给 ** ** ** ** ** ** ** ** ** ** ** ** **
14.04.2004	国際予備審査報告を作成した日 29.11.2004
名称及びあて先	株部 宣传本章 (1419 -)
日本国特許庁 (IPEA/JP)	
郵便番号100-8915 東京都千代田区額が関三丁目4番3	小堀 麻子 号
The state of the s	健性来导 03-3501

特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP03/15154

第1欄 報告の基礎	
1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出廊	の賃留を基礎とした。
□ この報告は、	4条)の相定に基づく命令に広気するもみに根叫され
出願時の国際出願啓類	
明細書 ページ、出願時に提 第 ページ*、 第 ページ*、 第 ページ*、	出されたもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 項、出願時に提第 第 項*、PCT19 第 項*、 第 項*、 第 項*、	出されたもの 条の規定に基づき補正されたもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの
図面 ページ/図、出願時に提第 第 ページ/図*、 第 ページ/図*、	
配列表又は関連するテーブル 配列表に関する補充欄を参照すること。 一	
3. 補正により、下記の書類が削除された。	ページ 項 ページ/図
4. この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかえてされたものと認められるので、その補正がされなかった	つ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超 ものとして作成した。 (PCT規則70.2(c))
請求の範囲 第 図面 第 図面 第 図列表 (具体的に記載すること) 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること)	項
* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されること	がある。

特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP03/15154

見解			
新規性(N)	請求の範囲 調求の範囲	1, 2	有
進歩性(IS)	請求の範囲	1, 2	
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲 請求の範囲	1, 2	 ·

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献 1: WO 98/54153 A1 (KOWA COMPANY LTD) 1998.12.03

文献 2: EP 334818 A1 (DOMPE FARMACEUTICI SPA) 1989.09.27

文献 3: US 3585194 A (ROHM AND HAAS CO) 1971. 06. 15

文献 4: DE 2209853 A1 (E. R. SQUIBB AND SONS INC) 1972.09.07 文献 5: US 5068264 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT) 1991.11.26

文献 1 には、1 ー(2 ーヒドロキシエチル)ピペラジンを出発物質とし、その二級アミンを保護基、好ましくは B o c 基で保護する過程を含む、1 ー [2 ー (ベンズイミダゾールー 2 ーイルチオ)エチル]ピペラジンの製造方法が記載されている(第21-23頁)。

文献 2 には、2 ーメルカプトー1 Hーベンゾイミダゾールと 1 ー (2 ークロロエチル) ー 4 ーメチルピペラジン塩酸塩とを反応させて 2 ー (2 ー (4 ーメチルピペラジンー1 ーイル) エチルチオ} ベンゾイミダゾールを得た過程が記載されている (Example 1)。

文献3、4、5には、それぞれN-ヒドロキシエチル-N' -ホルミルピペラジンが記載されている(文献3 PREPARATION F、文献4 Beispiel 20、文献5 Example 1)。

しかしながら、本願請求の範囲1、2に係る発明における、1ーホルミルー4ー(2ーヒドロキシエチル)ピペラジンを出発物質とする1ー[2ー(ベンズイミダゾールー2ーイルチオ)エチル]ピペラジンの製造方法は、国際調査報告で引用された上記文献のいずれにも記載されておらず、また、当業者といえども自明のものではない。

特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP03/15154

・第VI欄 ある種	の引用文献
-----------	-------

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

 出願番号 特許番号
 公知日 (日. 月. 年)
 出願日 (日. 月. 年)
 優先日(有効な優先権の主張) (日. 月. 年)

 WO 03/057675 A1 [E, X]
 17. 07. 2003
 27. 12. 2002
 28. 12. 2001

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類

書面による開示以外の開示の日付 (日.月.年)

書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)





PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

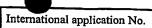
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

A1: 13	(10 30 and Rule 70)	
Applicant's or agent's file reference	FOR FURTHER	A CTTON	
KW0131		ACTION	See Form PCT/IPEA/416
International application No.	International filing of	late (day/month/year)	Priority date (day/month/year)
PCT/JP2003/015154		2003 (27.11.2003)	28 November 2002 (28.11.2002)
International Patent Classification (IPC) or na C07D 235/28, 295/18	ational classification a	and IPC	
Applicant			
	KOWA	CO., LTD.	
1. This report is the international prelim	inary examination re	nort established by this	International Preliminary Examining
Authority under Article 35 and transr	nitted to the applican	t according to Article 36	
2. This REPORT consists of a total of			
The same of a country of a country of a	sheets	s, including this cover sh	neet.
The repeat is also accompanied by A			
a. sent to the applicant and t	o the International Bi	ureau) a total of	sheets, as follows:
sheets of the descri	ption, claims and/or o	frawings which have he	en amended and are the basis of this report
and/or sheets conta Administrative Inst		uthorized by this Author	rity (see Rule 70.16 and Section 607 of the
	a decidency.		
	ure in the international	al application as filed, a	considers contain an amendment that goes s indicated in item 4 of Box No. I and the
b (sent to the International	<i>ll Bureau only)</i> a	total of (indicate type	e and number of electronic carrier(s)) and/or tables related thereto, in computer
readable form only, as ind Administrative Instructions		nental Box Relating to	and/or tables related thereto, in computer Sequence Listing (see Section 802 of the
4. This report contains indications relating		ems:	
Box No. I Basis of the repo			
Box No. II Priority			
Box No. III Non-establishme	ent of opinion with re-	gard to marrolty, improved	e step and industrial applicability
Box No. IV Lack of unity of	invention	gaid to noverty, inventiv	e step and industrial applicability
Box No. V Reasoned statem	ent under Article 350	2) with regard to novelty	y, inventive step or industrial applicability;
Box No. VI Certain documen	graphoreme	such statement	, a manufacture approaching,
	the international app		
Box No. VIII Certain observati	ons on the internation	nal application	
Date of submission of the demand		Date of completion of t	his report
14 April 2004 (14.04.200)4)		ember 2004 (29.11.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP		Authorized officer	
			i
Facsimile No.	ĺ	Telephone No.	1

Translation





PCT/JP2003/015154

Box No	. I	Basis of the report
1. With other	regare wise i	d to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless ndicated under this item.
	This which	report is based on translations from the original language into the following language, this language of a translation furnished for the purpose of:
		international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
		publication of the international application (under Rule 12.4)
		international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)
jurni.	re noi	d to the elements of the international application, this report is based on (replacement sheets which have been the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" tannexed to this report):
	The i	international application as originally filed/furnished
	the d	escription:
1	page	, as originary mediumsiled
Į.	page	Tootive by this rathority on
	page	received by this Authority on
	the c	laims:
	pages	, as originally interview
}	pages	, as amended (together with any statement) under Article 19
	pages	
	pages	received by this Authority on
	the d	rawings:
	pages	s, as originally filed/furnished
	pages	received by this Authority on
1	pages	received by this Authority on
	a seq	uence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.
, _	The	armondments have resulted in the control of
3		amendments have resulted in the cancellation of:
i	닏	the description, pages
	\square	the claims, Nos.
	Ш	the drawings, sheets/figs
Ì		the sequence listing (specify):
		any table(s) related to sequence listing (specify):
}		
4.	mauc	report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (70.2(c)). the description, pages
		the claims, Nos.
	\sqcup	the drawings, sheets/figs
		the sequence listing (specify):
		any table(s) related to sequence listing (specify):
* If iten	1 4 app	plies, some or all of those sheets may be marked "superseded."
<u> </u>		

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

1		
	Internal	application No.
	PCT/JP	03/15154

v.	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability;
	citations and explanations supporting such statement

-				
1.	Statement	•		
	Novelty (N)	Claims	1, 2	YES
		Claims		NO
	Inventive step (IS)	Claims	1, 2	YES
		Claims		NO
	Industrial applicability (IA)	Claims _	1, 2	YES
		Claims		NO

2. Citations and explanations

Document 1: WO 98/54153 A1 (Kowa Co., Ltd.), 03 December 1998

Document 2: EP 334818 A1 (Dompe Farmaceutici SPA), 27 September 1989

Document 3: US 3585194 A (Rohm And Haas Co.), 15 June 1971

Document 4: DE 2209853 Al (E. R. Squibb And Sons, Inc.), 07 September 1972

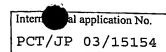
Document 5: US 5068264 A (Bayer AG.), 26 November 1991

Document 1 discloses a method for the production of 1-[2-(benzimidazole-2-ylthio) ethyl] piperazine which employs 1-(2-hydroxyethyl) piperazine as a starting material, wherein said method includes a step in which the secondary amine of the starting material is protected by means of a protective group, preferably by means of a Boc group (refer to pages 21 to 23).

Document 2 discloses a process in which 2-mercapto-1H-benzimidazole and 1-(2-chloroethyl)-4-methylpiperazine hydrochloride are reacted in order to obtain a 2-{2-(4-methylpiperazine-1-yl) ethylthio} benzimidazole (refer to example 1).

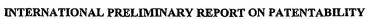
Documents 3, 4 and 5 disclose N-hydroxyethyl-N'-formylpiperazine (refer to document 3, preparation F;

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT



document 4, Beispiel 20; and document 5, example 1).

However, the method for the production of 1-[2-(benzimidazole-2-ylthio) ethyl] piperazine wherein 1-formyl-4-(2-hydroxyethyl) piperazine is used as a starting material in the invention that is set forth in claims 1 and 2 of the present application is not disclosed in any of the documents that are cited in the international search report, and is not obvious to a person skilled in the art.



International application No.

PCT/JP2003/015154

ertain published documents ((Rule 70.10)			
Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/ye	ar)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
WO 03/057675 A1	17 July 2003 (17.07.	2003) 27 December 2002	(27.12.2002)	28 December 2001 (28.12.20
[E, X]				
on-written disclosures (Rule	: 70.9)			
on-written disclosures (Rule Kind of non-written d		of non-written disclosure (day/month/year)	referring	e of written disclosure to non-written disclosure (day/month/year)
			referring	to non-written disclosure
			referring	to non-written disclosure
			referring	to non-written disclosure
			referring	to non-written disclosure
			referring	to non-written disclosure
			referring	to non-written disclosure